

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号
特表2003-500401
(P2003-500401A)

(43) 公表日 平成15年1月7日(2003.1.7)

(51) Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	テーマコード* (参考)
C 0 7 D 333/10		C 0 7 D 333/10	4 C 0 8 6
A 6 1 K 31/381		A 6 1 K 31/381	
A 6 1 P 35/00		A 6 1 P 35/00	

審査請求 有 予備審査請求 有 (全 61 頁)

(21) 出願番号 特願2000-619789(P2000-619789)
 (86) (22) 出願日 平成12年5月3日(2000.5.3)
 (85) 翻訳文提出日 平成13年11月19日(2001.11.19)
 (86) 国際出願番号 P C T / I B 0 0 / 0 0 5 7 0
 (87) 国際公開番号 W O 0 0 / 0 7 1 5 3 2
 (87) 国際公開日 平成12年11月30日(2000.11.30)
 (31) 優先権主張番号 6 0 / 1 3 4 , 9 3 3
 (32) 優先日 平成11年5月19日(1999.5.19)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(71) 出願人 ファイザー・プロダクツ・インク
 アメリカ合衆国コネチカット州グロトン市
 イースタン・ポイント・ロード
 (72) 発明者 ギャント, トーマス・ジョージ
 アメリカ合衆国コネチカット州06340, グ
 ロトン, イースタン・ポイント・ロード,
 ファイザー・インク, セントラル・リサー
 チ・ディヴィジョン
 (74) 代理人 弁理士 社本 一夫 (外5名)

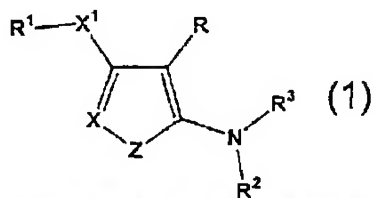
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 抗がん剤として有用な複素環式誘導体

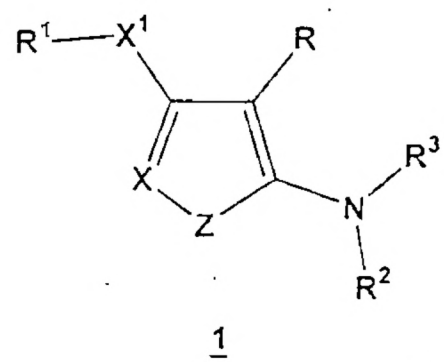
(57) 【要約】

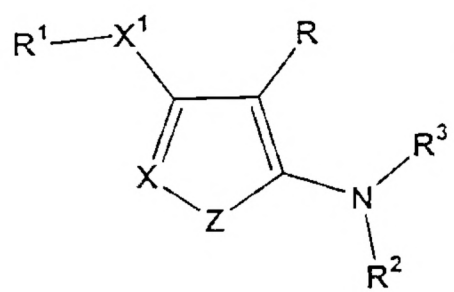
本発明は式(1) :

【化1】



の化合物ならびに薬剤として許容できるその塩類、プロ
 ドラッグおよび溶媒和物に関する。(式中、Z、X、X
 1、R1、R2及びR3は本明細書において、本発明が、哺
 乳動物の血管形成により仲介される疾患を前記化合物の
 投与によって治療するための前記化合物含有薬剤組成物
 に関連するように定義される。)





1

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

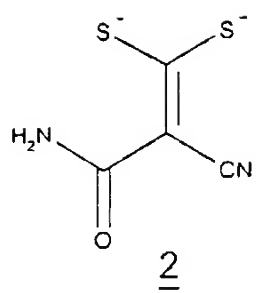
—

—

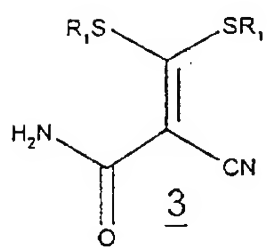
—

—

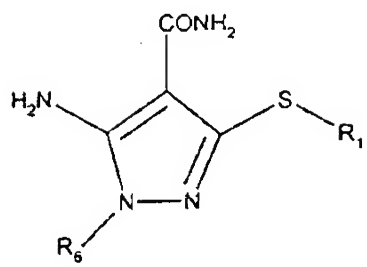
—



1



2



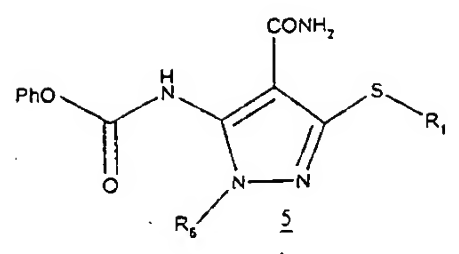
4



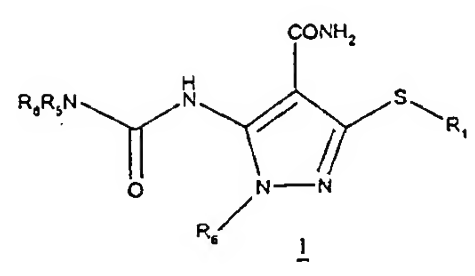
5

4

3



4



—

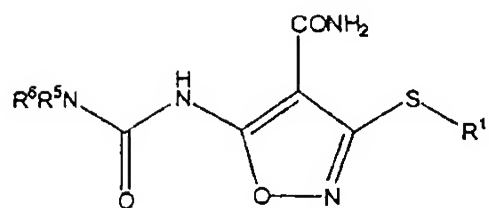
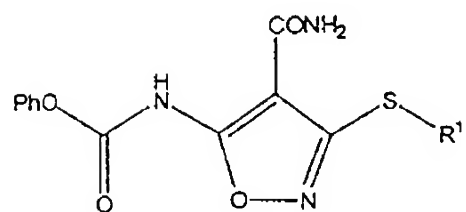
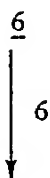
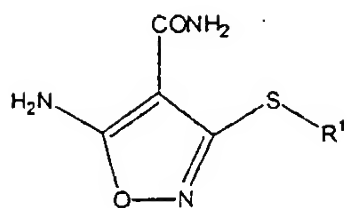
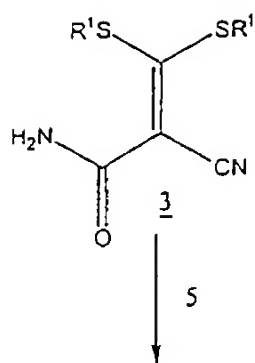
—

—

—

—

—



1

—

—

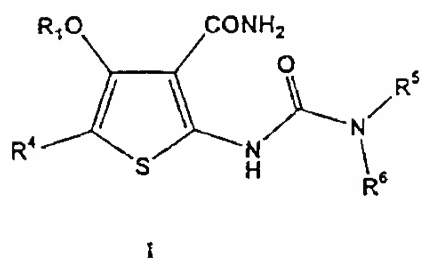
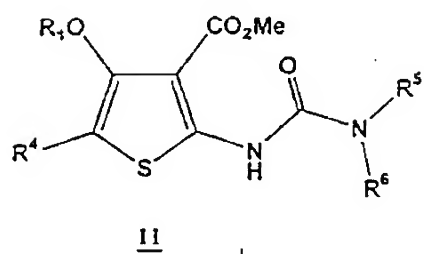
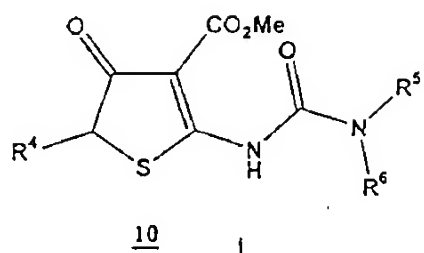
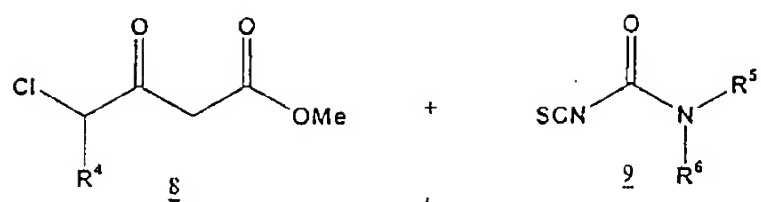
—

—

—

—

—

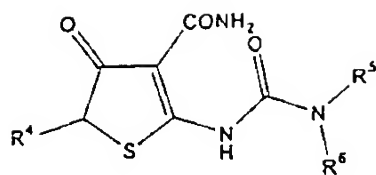


—

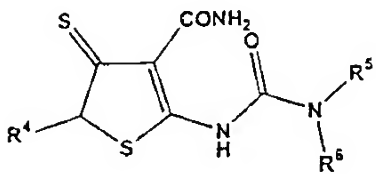
—

—

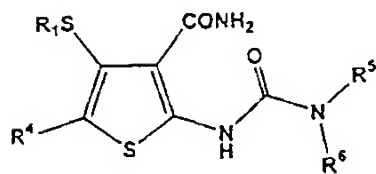
—



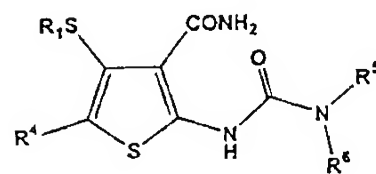
11



12



13



1

— —

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

—

————— —

—

—————

————— —

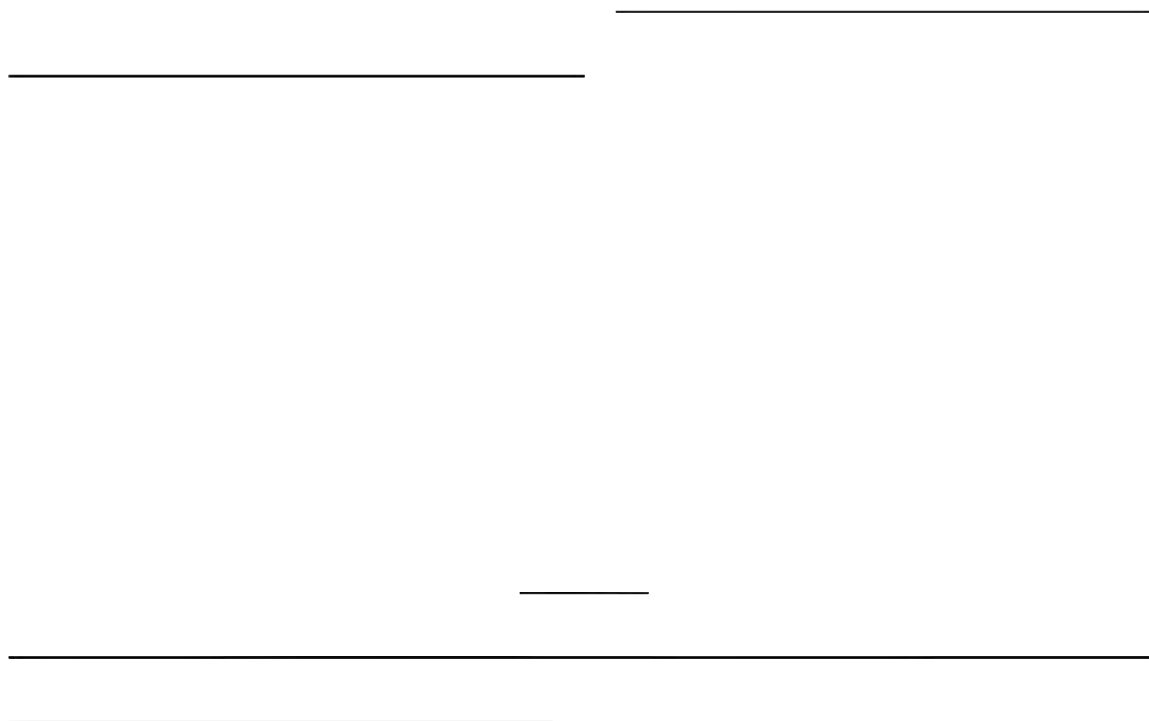
—————

————— —

—

—

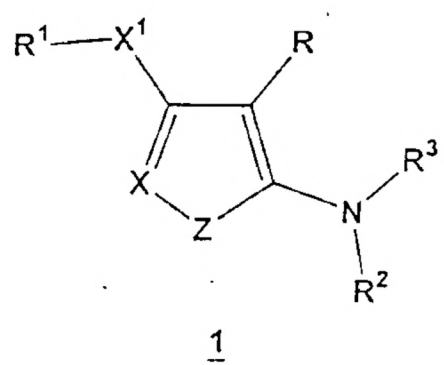
—

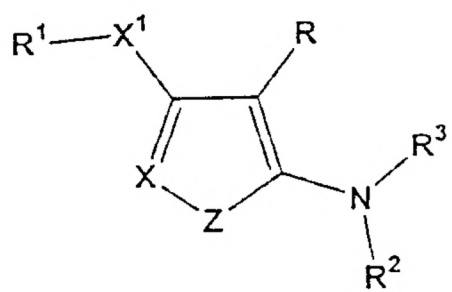


^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) 3.10 (br. s, 6H), 3.56 (s, 2H), 3.86 (s, 3H), 12.41 (s, 1H).

¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz) 1.03 (t, 3H, J = 7.3 Hz), 1.78-1.84 (m, 2H), 3.06 (s, 6H), 3.84-3.89 (m, 5H), 5.51 (s, 1H), 11.08 (s, 1H).

^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) 1.03 (t, 3H, $J = 7.3$ Hz), 1.81-1.88 (m, 2H), 3.04 (s, 6H), 3.97 (t, 2H, $J = 6.6$ Hz), 5.33 (ブロード s, 1H), 5.55 (s, 1H), 7.50 (ブロード s, 1H), 12.00 (s, 1H).





1

International Application No
PCT/IB 00/00570

3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
PCT/IB 00/00570

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indicator, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,X	WO 99 62890 A (PFIZER PRODUCTS INC., USA) 9 December 1999 (1999-12-09) cited in the application claims 1-18 ---	1-20
A	WO 98 52559 A (WILD HANNO ;LEE WENDY (US); SMITH ROGER A (US); WOOD JILL E (US);) 26 November 1998 (1998-11-26) claim 1; table 4 ---	1-20
X	WERBS, H. ET AL: "Reactions of 4-ethoxycarbonyl-3-amino-2-aminocarbonyl-5 - methylthiopyrazole with isocyanates and isothiocyanates" PHARMAZIE (1974), 29(10-11), 687-9, XP002142820 page 687; examples IIIA-IIIG ---	1
X	DATABASE CHEMABS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; LU, RONG-JIAN ET AL: "Regioselective addition of 5-amino-3-benzylthio-1,2,4-triazole and its analogs with aryl isocyanates" retrieved from STN Database accession no. 128:217329 XP002142821 1H-Pyrazole-4-carboxylic acid, 3-'''(3,4- dichlorophenyl)amino!carbonyl!amino!-5-''(p henylmethyl)thio!-, ethyl ester abstract & CHIN. J. CHEM. (1997), 15(6), 541-547, ---	1
X	US 4 057 416 A (GIBBONS LOREN KENNETH) 8 November 1977 (1977-11-08) claims 1,2,8,9,11,12,14,15,17 ---	1,2
A	US 4 059 433 A (GIBBONS LOREN KENNETH) 22 November 1977 (1977-11-22) claim 1 -----	1,2

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/IB 00/00570

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5773459	A	30-06-1998	AU 6049396 A WO 9640673 A	30-12-1996 19-12-1996
WO 9614843	A	23-05-1996	AU 700964 B AU 4156196 A CA 2203517 A CN 1165482 A EP 0788358 A JP 10509708 T US 5916908 A	14-01-1999 06-06-1996 23-05-1996 19-11-1997 13-08-1997 22-09-1998 29-06-1999
WO 9854116	A	03-12-1998	US 6037340 A AU 7604198 A	14-03-2000 30-12-1998
WO 9962890	A	09-12-1999	AU 3342199 A	20-12-1999
WO 9852559	A	26-11-1998	AU 7585598 A EP 0986382 A	11-12-1998 22-03-2000
US 4057416	A	08-11-1977	NONE	
US 4059433	A	22-11-1977	NONE	

